

(19)日本国特許庁 (J P)

(12) 公開特許公報 (A)

(11)特許出願公開番号

特開平7-48260

(43)公開日 平成7年(1995)2月21日

(51)Int.Cl.⁶ 識別記号 庁内整理番号 F I 技術表示箇所
A 6 1 K 31/56 A B Y 9454-4C
35/78 X 8217-4C
// C 0 7 J 63/00 9051-4C

審査請求 未請求 請求項の数1 FD (全4頁)

(21)出願番号	特願平5-211065	(71)出願人 000231109 株式会社ジャパンエナジー 東京都港区虎ノ門二丁目10番1号
(22)出願日	平成5年(1993)8月4日	(72)発明者 松原 純子 神奈川県横浜市鶴見区馬場 2-12-10 (72)発明者 米澤 司郎 大阪府堺市三原台 2-4-10 (74)代理人 弁理士 並川 啓志

(54)【発明の名称】 血球増加剤

(57)【要約】

【目的】 副作用が少なく、血小板や赤血球等の血球を著しく増加させ、延命作用を有する血球増加剤の提供。

【構成】 ウルソール酸またはその塩を有効成分とする血球増加剤。

1

【特許請求の範囲】

【請求項1】 ウルソール酸またはその塩を有効成分とする血球増加剤。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【産業上の利用分野】 本発明は、血球増加剤、特に、放射線被曝や薬の副作用による血球の減少の際に用いることができる血球増加剤に関する。

【0002】

【従来の技術】 癌の放射線療法や化学療法を行なうと、血球細胞の分化増殖の阻害を含む造血機能の抑制が生じ、免疫機能が低下する等の副作用が生じる。これらの療法により生体内に細胞障害性の強いフリーラジカルが産生されることが知られており、そのスカベンジング作用を利用した幾つかの副作用軽減剤が開発されている。

【0003】 この副作用軽減剤としてラジカルスカベンジャーであるWR-2721やS-P等が、また造血機能促進剤である糖蛋白の造血因子を利用する顆粒球コロニー形成刺激因子(G-CSF)、エリスロポエチニン(EPO)、顆粒球マクロファージコロニー形成刺激因子(GM-CSF)、インターロイキン3(IL-3)、コロニー形成刺激因子1(CSF-1)等が開発されている。しかし、これらには、発熱など副作用の激しいものが多く、実際に臨床に用いることが困難な状況にある。

【0004】

【発明が解決しようとする課題】 本発明者等は、多年、放射線防護作用について研究を進め、この過程で、ウルソール酸が放射線被曝により減少した血小板や赤血球を増加、回復させ、延命作用を有することを見出し、本発明に想倒した。

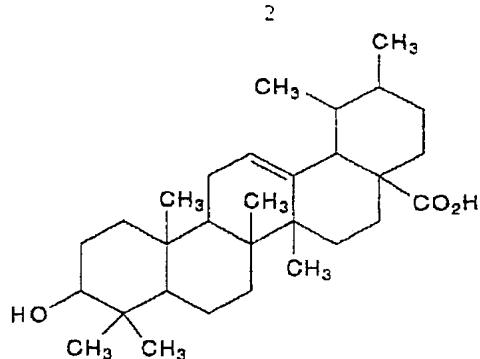
【0005】 すなわち、本発明の目的は、副作用が少なく、血小板や赤血球等の血球を著しく増加させ、延命作用を有する血球増加剤を提供することにある。

【0006】

【課題を解決するための手段】 本発明の血球増加剤は、ウルソール酸またはその塩を有効成分として含有させることからなるものである。ウルソール酸は、ウウルシ、リンゴ、サクランボなどの果実や葉のろう状物質として広く分布しているもので、下記一般式(I)で示される構造を有している。

【化1】

10



20

【0007】 このウルソール酸は、植物体から、一般的な有機溶剤、例えばメタノール、エタノール、プロパンノール等のアルコール類を用いて容易に抽出分離でき、この抽出精製物を用いることができるが、化学的合成品を用いても良い。このウルソール酸は、ナトリウム、カリウム等の無機塩、酢酸、クエン酸などの有機酸塩としても用いることができる。

【0008】 このウルソール酸または塩は、日常食する果実や漢方生薬に含まれている物質であり、毒性が極めて低く、極めて安全性の高い物質である。本発明の血球増加剤を患者に投与する場合、症状の程度、患者の年齢、体重、

【0009】 さらには健康状態等を勘案してその量を決定するが、一般的には、成人1日当たり約0.1～100.0mgを経口あるいは非経口的に1日1回若しくはそれ以上投与すれば良い。

【0010】 また本発明の血球増加剤は、例えば、注射剤、散剤、細粒剤、顆粒剤、錠剤、カプセル剤、坐剤などの剤型で投与することができる。さらに、経口用固形製剤として用いる場合は、ウルソール酸若しくはこの塩に賦形剤、結合剤、崩壊剤、滑沢剤、着色剤などを加え、散剤、細粒剤、顆粒剤、錠剤、カプセル剤等の薬剤として調製することが好ましい。この場合の賦形剤としては、乳糖、コーンスター、ブドウ糖、マンニトール、結晶セルロースなど、結合剤としては、ポリビニルアルコール、ポリビニルエーテル、エチルセルロース、メチルセルロース、ヒドロキシプロビルセルロース、ポリビニルビロリドンなど、崩壊剤としては、デンプン、寒天、炭酸カルシウムなど、滑沢剤としては、ステアリン酸マグネシウム、タルクなどが用いられる。錠剤、顆粒剤は必要により、白糖、ゼラチン、ヒドロキシプロビルセルローズなどで被膜しても良い。

【0011】 注射剤は、ウルソール酸若しくはこの塩に、必要に応じ、pH調整剤、緩衝剤、安定化剤、可溶化剤等を添加して調製することができる。

【0012】

【実施例】

(試験例) 5週令のICR系マウス(雄)10匹を一群とし、3分以内に5.5GyのX線を全身照射し、次いでこ

30

40

50

【図1】

